

PCT/JP 2004/009215

日本国特許庁
JAPAN PATENT OFFICE

23. 6. 2004

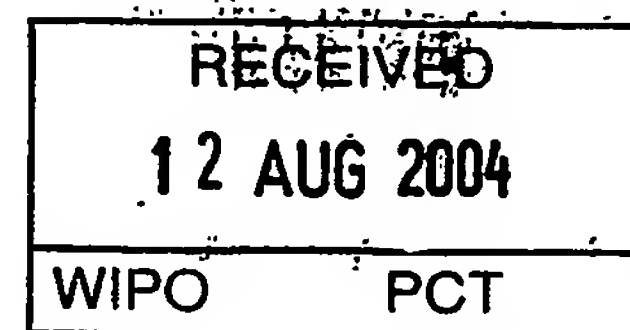
別紙添付の書類に記載されている事項は下記の出願書類に記載されている事項と同一であることを証明する。

This is to certify that the annexed is a true copy of the following application as filed with this Office.

出願年月日
Date of Application: 2003年 8月 6日

出願番号
Application Number: 特願 2003-288300
[ST. 10/C]: [JP 2003-288300]

出願人
Applicant(s): 住化ファインケム株式会社

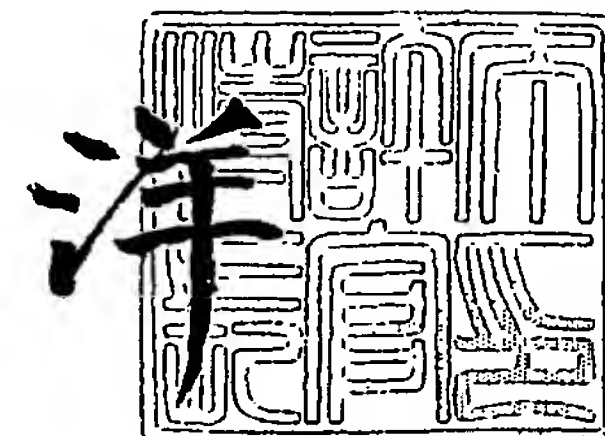


PRIORITY DOCUMENT
SUBMITTED OR TRANSMITTED IN
COMPLIANCE WITH
RULE 17.1(a) OR (b)

2004年 7月30日

特許庁長官
Commissioner,
Japan Patent Office

小川



出証番号 出証特 2004-3067580

【書類名】 特許願
【整理番号】 A6025
【提出日】 平成15年 8月 6日
【あて先】 特許庁長官殿
【国際特許分類】 C07B 51/00
C07B 41/04
C07C 43/30

【発明者】
【住所又は居所】 大阪市西淀川区歌島3丁目1番21号 住化ファインケム株式会
社 総合研究所内
【氏名】 渡邊 要介

【発明者】
【住所又は居所】 大阪市西淀川区歌島3丁目1番21号 住化ファインケム株式会
社 総合研究所内
【氏名】 池本 哲哉

【特許出願人】
【識別番号】 592120519
【氏名又は名称】 住化ファインケム株式会社

【代理人】
【識別番号】 100080791
【弁理士】
【氏名又は名称】 高島 一
【電話番号】 06-6227-1156

【手数料の表示】
【予納台帳番号】 006965
【納付金額】 21,000円

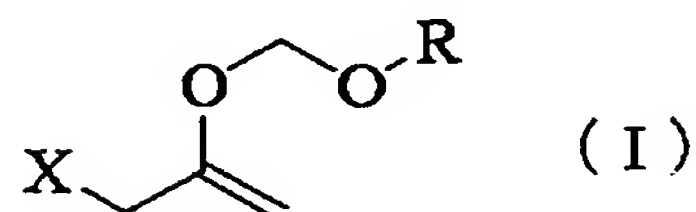
【提出物件の目録】
【物件名】 特許請求の範囲 1
【物件名】 明細書 1
【物件名】 要約書 1
【包括委任状番号】 9908856

【書類名】 特許請求の範囲

【請求項 1】

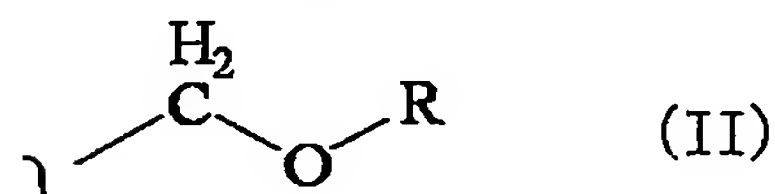
一般式 (I) :

【化 1】



(式中、Rは置換基を有していてもよいフェニル基または置換基を有していてもよいアルキル基を示し、Xはハロゲン原子を示す。) で表される化合物と水酸基含有化合物とを、酸触媒存在下反応させて、該水酸基含有化合物の水酸基の水素原子を、一般式 (II) :

【化 2】



(式中、Rは前記と同義を示す。) で表される保護基に置換することを特徴とする、水酸基の保護方法。

【請求項 2】

酸触媒が、ピリジニウム p-トルエンスルホネートである請求項 1 記載の水酸基の保護方法。

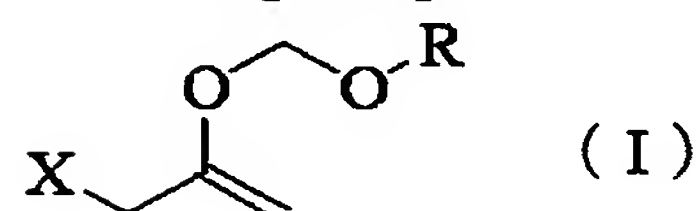
【請求項 3】

Rがアルキル基である請求項 1 または 2 記載の水酸基の保護方法。

【請求項 4】

一般式 (I) :

【化 3】



(式中、Rは置換基を有していてもよいフェニル基または置換基を有していてもよいアルキル基を示し、Xはハロゲン原子を示す。) で表される化合物を含有する水酸基保護試薬。

【請求項 5】

Rがアルキル基である請求項 4 記載の水酸基保護試薬。

【請求項 6】

Rがメチル基である請求項 5 記載の水酸基保護試薬。

【書類名】 明細書

【発明の名称】 水酸基保護試薬およびそれを用いた水酸基の保護方法

【技術分野】

【0001】

本発明は、メトキシメチル基等のアセタール型保護基による水酸基の保護に有用な保護試薬および当該保護試薬を用いた水酸基の保護方法に関する。

【背景技術】

【0002】

水酸基、アミノ基等の官能基を有する化合物の有機合成において、これら官能基を適切に保護することが、合成戦略上重要である。

【0003】

一般式 (II) : $-CH_2OR$ (II) (式中、Rは置換基を有していてもよいフェニル基または置換基を有していてもよいアルキル基を示す。) で表されるアセタール型保護基 (例えば、メトキシメチル基、エトキシメチル基、メトキシエトキシメチル基等、以下、保護基 (II) ともいう。) は水酸基の保護基として利用されており、種々の反応条件に安定であり、弱酸性条件で容易に脱保護できることから、水酸基の保護基としての利用価値が高い。

【0004】

水酸基を保護基 (II) で保護する方法としては、1) 少過剰のジイソプロピルエチルアミン存在下でアルコキシメチルクロリドを滴下し反応させる方法、2) 強酸触媒存在下で大過剰のジアルコキシメタンを加熱反応させる方法が知られている (非特許文献1 参照)。

【0005】

しかしながら、1) の反応系は塩基性条件であり、塩基に不安定なアルコールの保護には適用できない他、毒性の強いアルコキシメチルクロリドを使用するという問題点があった。また、2) の反応系は強酸性であり、酸に不安定なアルコールには適用できない他、大過剰のジアルコキシメタンを使用するため経済的ではなく、さらには平衡反応であるため反応が複雑になりやすいなどの問題があった。

【0006】

このため、酸や塩基に不安定なアルコールを含む一般性のあるアルコールに対して、温和な条件で保護基 (II) を導入できる方法が望まれる。

【非特許文献1】セオドア W. グリーン (Theodora W. Greene), ピーター G. M. ワッツ (Peter G. M. Wuts) 著, 「プロテクティブグループスインオルガニックシンセシス (Protective Groups in Organic Synthesis)」, (米国), 第3版, ウィリーインターサイエンス, ジョンウィリー&サンズ, インク (Wiley Interscience Publication, John Wiley & Sons, Inc.), 1999年, p. 27-49.

【発明の開示】

【発明が解決しようとする課題】

【0007】

本発明の目的は、温和な条件で水酸基にアセタール型保護基を導入し得る方法およびそのための保護試薬を提供することである。

【課題を解決するための手段】

【0008】

本発明者等は、上記課題を解決するため鋭意研究した結果、弱酸性条件下で水酸基に保護基 (II) を収率よく導入し得る試薬を見出し、本発明を完成させた。

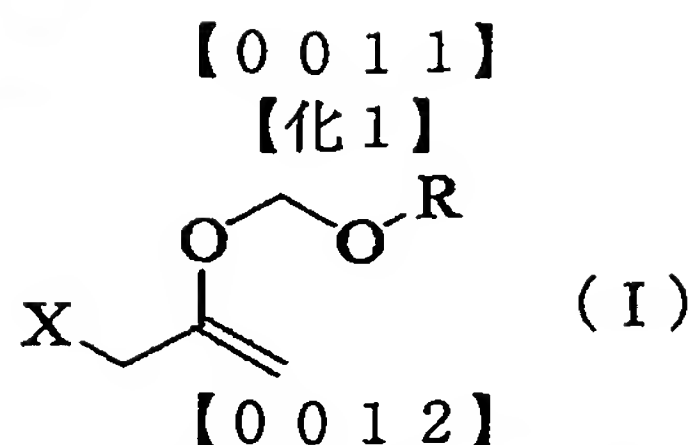
【0009】

すなわち、本発明は以下のとおりである。

【発明の効果】

【0010】

(1) 一般式 (I) :



(式中、Rは置換基を有していてもよいフェニル基または置換基を有していてもよいアルキル基を示し、Xはハロゲン原子を示す。) で表される化合物〔以下、化合物(I)ともいう。〕と水酸基含有化合物とを、酸触媒存在下反応させて、該水酸基含有化合物の水酸基の水素原子を、保護基(II)に置換することを特徴とする、水酸基の保護方法。

(2) 酸触媒が、ピリジニウム p-トルエンスルホネートである上記(1)記載の水酸基の保護方法。

(3) Rがアルキル基である上記(1)または(2)記載の水酸基の保護方法。

(4) 化合物(I)を含有する水酸基保護試薬。

(5) Rがアルキル基である上記(4)記載の水酸基保護試薬。

(6) Rがメチル基である上記(5)記載の水酸基保護試薬。

【発明を実施するための最良の形態】

【0013】

以下に、本発明について詳細に説明する。

【0014】

本発明において、各置換基の定義は以下のとおりである。

【0015】

Xで示される「ハロゲン原子」としては、フッ素原子、塩素原子、臭素原子、ヨウ素原子が挙げられ、塩素原子、臭素原子が好ましい。より好ましくは塩素原子である。

【0016】

Rで示される「置換基を有していてもよいアルキル基」の「アルキル基」としては、炭素数1～8の直鎖状または分枝鎖状のアルキル、例えば、メチル、エチル、プロピル、イソプロピル、ブチル、イソブチル、sec-ブチル、tert-ブチル、ペンチル、イソペンチル、sec-ペンチル、tert-ペンチル、ネオペンチル、ヘキシル、イソヘキシル、ヘプチル、イソヘプチル、オクチル、イソオクチル等が挙げられ、好ましくはメチル、エチル等が挙げられる。

【0017】

Rにおいて「アルキル基」および「フェニル基」が有していてもよい置換基としては、アルキル基(上記と同様のものが例示される。但しアルキル基の置換基とはならない。)、ハロゲン原子(上記と同様のものが例示される。)、アルコキシ基(炭素数1～4の直鎖状または分枝鎖状のアルコキシ基、例えば、メトキシ、エトキシ、プロポキシ、イソプロポキシ、ブトキシ、イソブトキシ、tert-ブトキシ等)等が挙げられる。

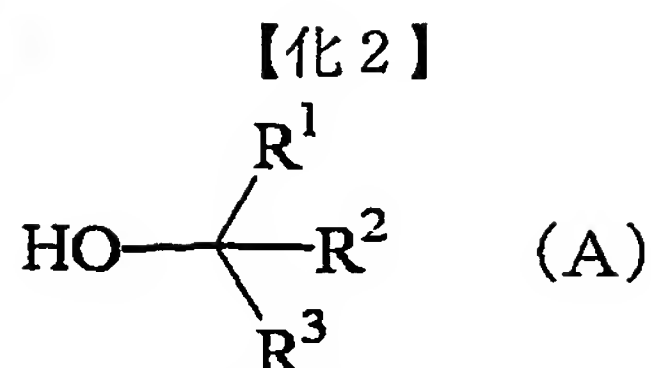
【0018】

Rとしては、「置換基を有していてもよいアルキル基」が好ましく、「アルキル基」がより好ましく、メチルがさらに好ましい。

【0019】

水酸基含有化合物とは、およそ分子内に水酸基を有する有機化合物であれば特に限定されることはなく、フェノール性水酸基であっても、脂肪族アルコールであってもよく、また第1級アルコール、第2級アルコール、第3級アルコールを問わず、本発明に適用可能であり、例えば、下記一般式(A)：

【0020】



【0021】

(式中、 R^1 、 R^2 および R^3 は同一または異なって、それぞれ独立して、水素原子、アルコキシカルボニル基、アシル基、置換基を有していてもよいアルキル基、置換基を有していてもよいアリール基、置換基を有していてもよいアラルキル基、置換基を有していてもよいヘテロアリール基等を示すか、または、 R^1 および R^2 が結合する炭素原子と一緒に、置換基を有していてもよい同素環または複素環を形成してもよい。) で表されるアルコール化合物 (以下、アルコール (A) ともいう。) を好適に使用することができるが、これに限定されるものではない。

【0022】

アルコール (A) において「アルコキシカルボニル基」としては、そのアルキル部分が R において例示されたアルキル基であるアルコキシカルボニル基、例えば、メトキシカルボニル、エトキシカルボニル、プロポキシカルボニル、イソプロポキシカルボニル、ブトキシカルボニル、イソブトキシカルボニル、tert-ブトキシカルボニル等が挙げられる。

【0023】

アルコール (A) における「アシル基」としては、炭素数 2～5 のアシル基、例えば、アセチル、プロピオニル、イソプロピオニル、ブチリル、イソブチリル、ピバロイル等が挙げられる。

【0024】

アルコール (A) における「置換基を有していてもよいアルキル基」の「アルキル基」としては、R で定義されたアルキル基と同じものが挙げられる。

【0025】

アルコール (A) における「置換基を有していてもよいアリール基」の「アリール基」としては、炭素数 1～20 のアリール基、例えばフェニル、1-または2-ナフチル、ビフェニル、ピナフチル等が挙げられる。

【0026】

アルコール (A) における「置換基を有していてもよいアラルキル基」の「アラルキル基」としては、例えば上記で定義された「アルキル基」の任意の位置に上記で定義された「アリール基」が置換して形成されるアラルキル基、例えばベンジル、1-または2-フェネチル、1-、2-または3-フェニルプロピル、1-または2-ナフチルメチル、ベンゾヒドリル、トリチル等が挙げられる。

【0027】

アルコール (A) における「置換基を有していてもよいヘテロアリール基」の「ヘテロアリール基」としては、例えば炭素原子以外に酸素原子、硫黄原子及び窒素原子から選ばれるヘテロ原子を 1～4 個含む 5～7 員の芳香性を有する複素環基、及びその縮合ヘテロ環基等が挙げられる。例えば 2-又は 3-チエニル、2-又は 3-フリル、1-、2-又は 3-ピロリル、1-、2-、4-又は 5-イミダゾリル、2-、4-又は 5-オキサゾリル、2-、4-又は 5-チアゾリル、1-、3-、4-又は 5-ピラゾリル、3-、4-又は 5-イソオキサゾリル、3-、4-又は 5-イソチアゾリル、1, 2, 4-トリアゾール-1, 3, 4 又は 5-イル、1, 2, 3-トリアゾール-1, 2 又は 4-イル、1H-テトラゾール-1 又は 5-イル、2H-テトラゾール-2 又は 5-イル、2-、3-又は 4-ピリジル、2-、4-又は 5-ピリミジニル、1-、2-、3-、4-、5-、6-又は 7-インドリル、2-、3-、4-、5-、6-又は 7-ベンゾフリル、2-、3-、4-、5-、6-又は 7-ベンゾチエニル、1-、2-、4-、5-、6-又は 7-ベンズイミダゾリル、2-、3-、4-、5-、6-、7-又は 8-キノリル、1-、

3-、4-、5-、6-、7-又は8-イソキノリル等が挙げられる。

【0028】

R^1 および R^2 が結合する炭素原子と一緒に形成してもよい、置換基を有していてもよい同素環としては、炭素数3～8の脂肪族同素環、例えば、シクロプロパン、シクロブタン、シクロペンタン、シクロヘキサン、シクロヘプタン、シクロオクタン等が挙げられる。

【0029】

R^1 および R^2 が結合する炭素原子と一緒に形成してもよい、置換基を有していてもよい複素環としては、炭素数3～7の脂肪族複素環、例えば、テトラヒドロピラン、テトラヒドロフラン、ピロリジン、ピペリジン、モルホリン、チオモルホリン、ピペラジン、テトラヒドロチオフエン、テトラヒドロチオピラン等が挙げられる。

【0030】

上記「アルキル基」、「アリール基」、「アラルキル基」、「ヘテロアリール基」、「同素環」または「複素環」は、置換可能な位置に置換基を有していてもよく、置換基としては、例えばアルキル基（上記で定義されたものと同じものが例示される。但し、アルキル基の置換基とはならない。）、ハロゲン原子（上記で定義されたものと同じものが例示される。）、アルコキシカルボニル基（上記で定義されたものと同じものが例示される。）、アシル基（上記で定義されたものと同じものが例示される。）、オキソ、ニトロ基、シアノ基等が挙げられるが、これらに限定されるものではない。当該置換基の数は特に限定はなく、1～4個が好ましく、同一または異なってもよい。

【0031】

アルコール（A）としては、 R^1 、 R^2 又は R^3 のうち、いずれか一つが水素原子のもの、すなわち第2級アルコールが、収率が良好であることから好ましい。

【0032】

アルコール（A）のうちでも、特に、医薬品の合成中間体（例えば、D又はL-乳酸エステル、（S）又は（R）- β -ヒドロキシ- γ -ブチロラクトン、（S）又は（R）-4-クロロ-3-ヒドロキシブタン酸エステル、（S）又は（R）-3-ヒドロキシテトラデカン酸エステル等）のような光学活性アルコールまたは β -ヒドロキシエステル等は、強塩基性条件または強酸性条件で、ラセミ化、脱離反応等を起こしやすく不安定であるため、弱酸性条件で行い得る本発明の保護方法に好適に使用できる。

【0033】

さらに水酸基含有化合物として、糖類、水酸基含有アミノ酸（セリン、チロシン等）または当該アミノ酸を含むペプチド類、核酸類等の天然物またはその合成中間体にも本発明の保護方法を好適に適用できる。

【0034】

本発明の水酸基の保護方法は、例えば溶媒中において、化合物（I）と水酸基含有化合物とを、酸触媒存在下反応させて、該水酸基含有化合物の水酸基の水素原子を、保護基（II）に置換することで達成される。試薬の添加順序は特に限定はなく、各試薬を順次または同時に添加すればよい。

【0035】

化合物（I）は、上記R及びXで定義されるものであれば特に制限されないが、入手容易であることから、2-（クロロメチル）-3, 5-ジオキサヘキサ-1-エンが好ましい。

【0036】

水酸基含有化合物も上記のとおり特に制限されないが、収率が良好であることから、脂肪族第2級アルコール類が好ましい。

【0037】

使用される酸触媒としては、例えばピリジニウム p-トルエンスルホネート、p-トルエンスルホン酸、ベンゼンスルホン酸、メタンスルホン酸、トリフルオロメタンスルホン酸、酸性イオン交換樹脂等が挙げられ、ピリジニウム p-トルエンスルホネートが弱酸性

であることから好ましい。

【0038】

化合物 (I) の使用量は、水酸基含有化合物 1 モルに対して、0.9 モル～1.5 モルが好ましく、1.0 モル～1.3 モルがより好ましい。

【0039】

酸触媒の使用量は、水酸基含有化合物 1 モルに対して、0.0001 モル～0.5 モルが好ましく、0.001 モル～0.1 モルがより好ましい。この範囲より少ないと反応が遅くなる傾向がある。

【0040】

使用される溶媒としては、当該反応を阻害しないものであれば特に限定はなく、例えばアセトニトリル、ベンゾトリフルオリド、テトラヒドロフラン (THF)、ジクロロメタン、トルエン、クロロベンゼン、メチル *tert*-ブチルエーテル等を単独または混合して用いることができ、アセトニトリルまたはベンゾトリフルオリドが好ましい。混合溶媒とする場合は、任意の割合で混合すればよい。

【0041】

溶媒の使用量としては、水酸基含有化合物 1 kg に対して、1 L～50 L の範囲が好ましい。

【0042】

反応温度は、通常は-20℃～100℃であるが、0℃～50℃が好ましい。反応時間は、通常10分～60時間である。

【0043】

水酸基が保護された水酸基含有化合物は、反応終了後、定法により単離、精製することができる。例えば、反応混合物に水または炭酸水素ナトリウム水溶液等を加え、有機溶媒にて抽出後、有機層を濃縮することにより、水酸基が保護された水酸基含有化合物を単離することができる。さらには、通常の精製法、例えば、再結晶、シリカゲルカラムクロマトグラフィーまたは減圧蒸留等によって精製することができる。

【0044】

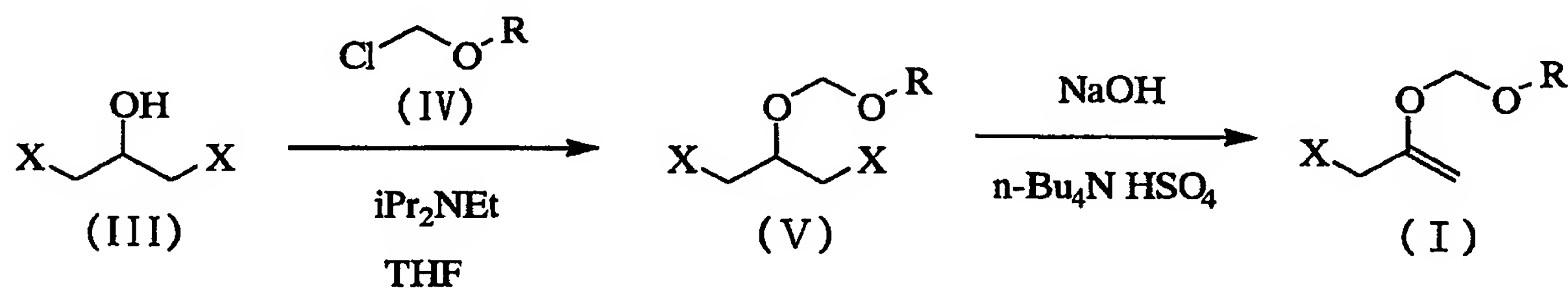
このようにして得られた水酸基が保護された水酸基含有化合物の保護基 (II) は、公知の方法、例えば上記非特許文献 1 に記載の方法によって、脱保護することができる。

【0045】

本発明において、水酸基保護試薬として使用される化合物 (I) は、以下のスキームで表される方法により合成することができるが (J. Org. Chem., 5425, (1986) 参照)、入手可能なものは市販品を用いてもよい。

【0046】

【化 3】



【0047】

(式中、各記号は前記と同義を示す。)

一般式 (III) で表される化合物をテトラヒドロフラン (THF) 中、N, N-ジイソプロピルエチルアミンの存在下、一般式 (IV) で表される化合物と反応させて、一般式 (V) で表される化合物を得、次いで硫酸水素テトラ *n*-ブチルアンモニウムのような相間移動触媒存在下、水酸化ナトリウムと反応させることにより、化合物 (I) を合成することができる。以下、各工程について説明する。

【0048】

第1工程

一般式(IV)で表される化合物は、一般式(III)で表される化合物1モルに対して、0.8モル～1.5モルの範囲で用いられる。

【0049】

N, N-ジイソプロピルエチルアミンは、一般式(III)で表される化合物1モルに対して、1モル～2モルの範囲で用いられる。

【0050】

THFは、一般式(III)で表される化合物1gに対して、1mL～50mLの範囲で用いられる。

【0051】

反応温度は、通常-20℃～80℃であり、反応時間は0.5時間～15時間程度である。

【0052】

反応終了後、一般式(V)で表される化合物は、抽出、水洗、濃縮により反応混合物より単離することができる。

【0053】

第2工程

第2工程は、無溶媒で行うことができる。

【0054】

水酸化ナトリウムは、微粒状のものが好ましく、一般式(V)で表される化合物1モルに対して、1モル～5モルの範囲で用いられる。

【0055】

相間移動触媒は、硫酸水素テトラ n-ブチルアンモニウムが好ましく、一般式(V)で表される化合物1モルに対して、0.01モル～1モルの範囲で用いられる。

【0056】

反応温度は、通常20℃～150℃であり、反応時間は0.5～24時間程度である。

【0057】

反応終了後、化合物(I)は、シリカゲルカラムクロマトグラフィーや減圧蒸留等により精製することができる。

【0058】

以下、本発明について、実施例を挙げてさらに具体的に説明する。本発明はこれらにより何ら限定されるものではない。

【実施例1】

【0059】

L-乳酸メチルのメトキシメチルエーテル化

L-乳酸メチル(208mg, 2mmol)をベンゾトリフルオリド(2.0mL)に溶解させ、ピリジニウム p-トルエンスルホネート(PPTS, 50mg, 0.2mmol)を加えた後、2-(クロロメチル)-3,5-ジオキサヘキサー1-エン(東京化成社製, 327mg, 2.4mmol)を加え、室温で24時間攪拌した。反応液に飽和炭酸水素ナトリウム水溶液(3mL)を加え、酢酸エチル(4mL)で抽出した。有機層はさらに飽和炭酸水素ナトリウム水溶液(2mL)で洗浄後、無水硫酸マグネシウム(0.5g)上で脱水した後、減圧留去することにより、(S)-2-(メトキシメトキシ)プロピオン酸メチル(248mg, 収率84%)を得た。

【0060】

¹H-NMR(CDC1₃, 400MHz) δ ppm: 1.44(3H, d, J=7Hz), 3.39(3H, s), 3.75(3H, s), 4.24(1H, q, J=7Hz), 4.69(1H, d, J=7Hz), 4.70(1H, d, J=7Hz).

【実施例2】

【0061】

L-乳酸メチルのメトキシメチルエーテル化

ベンゾトリフルオリドの代わりにアセトニトリル 2.0 mL を使用した以外は、実施例 1 と同様に行い、(S)-2-(メトキシメトキシ)プロピオン酸メチル (256 mg, 収率 86%) を得た。

【実施例 3】

【0062】

(S)- β -ヒドロキシ- γ -ブチロラク톤のメトキシメチルエーテル化

L-乳酸メチルの代わりに (S)- β -ヒドロキシ- γ -ブチロラク톤 (204 mg, 2 mmol) を使用し、反応時間を 15 時間にした以外は実施例 1 と同様に行い、対応する (S)- β -(メトキシメトキシ)- γ -ブチロラク톤 (226 mg, 収率 77%) を得た。

【0063】

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl₃, 400 MHz) δ ppm: 2.61 (1H, dd, $J=18\text{ Hz}$, $J=3\text{ Hz}$), 2.74 (1H, dd, $J=18\text{ Hz}$, $J=6\text{ Hz}$), 3.39 (3H, s), 4.36 (1H, dd, $J=10\text{ Hz}$, $J=2\text{ Hz}$), 4.42 (1H, dd, $J=10\text{ Hz}$, $J=5\text{ Hz}$), 4.48-4.52 (1H, m), 4.68 (2H, s).

【実施例 4】

【0064】

(S)-4-クロロ-3-ヒドロキシブタン酸エチルのメトキシメチルエーテル化

L-乳酸メチルの代わりに (S)-4-クロロ-3-ヒドロキシブタン酸エチル (333 mg, 2 mmol) を使用し、反応時間を 15 時間にした以外は実施例 1 と同様に行い、対応する (S)-4-クロロ-3-(メトキシメトキシ)ブタン酸エチル (400 mg, 95%) を得た。

【0065】

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl₃, 400 MHz) δ ppm: 1.28 (3H, t, $J=7\text{ Hz}$), 2.66 (1H, dd, $J=16\text{ Hz}$, $J=7\text{ Hz}$), 2.72 (1H, dd, $J=16\text{ Hz}$, $J=5\text{ Hz}$), 3.40 (3H, s), 3.69 (2H, d, $J=5\text{ Hz}$), 4.16 (2H, q, $J=7\text{ Hz}$), 4.20-4.26 (1H, m), 4.70 (1H, d, $J=7\text{ Hz}$), 4.75 (1H, d, $J=7\text{ Hz}$).

【実施例 5】

【0066】

(S)-3-ヒドロキシテトラデカン酸エチルのメトキシメチルエーテル化

(S)-3-ヒドロキシテトラデカン酸エチル (2.00 g, 7.3 mmol) 及び 2-(クロロメチル)-3,5-ジオキサヘキサ-1-エン (東京化成社製, 1.20 g, 8.8 mmol) を THF (10 mL) に溶解させ、p-トルエンスルホン酸 (10 mg) を加え、室温で 15 時間攪拌した。反応液にトリエチルアミン (1 mL) 流入した後、飽和炭酸水素ナトリウム水溶液 (10 mL) と飽和食塩水 (10 mL) で洗浄後、無水硫酸マグネシウム (0.5 g) 上で脱水濾過後、溶媒を留去することにより、対応する (S)-3-メトキシメトキシテトラデカン酸エチル (2.20 g, 収率 95%) を得た。

【0067】

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl₃, 400 MHz) δ ppm: 0.88 (3H, t, $J=7\text{ Hz}$), 1.20-1.40 (18H, m), 1.47-1.60 (2H, m), 2.45 (1H, dd, $J=15\text{ Hz}$, $J=5\text{ Hz}$), 2.56 (1H, dd, $J=15\text{ Hz}$, $J=7\text{ Hz}$), 3.92-4.02 (1H, m), 4.14 (2H, q, $J=7\text{ Hz}$), 4.65 (1H, d, $J=7\text{ Hz}$), 4.68 (1H, d, $J=7\text{ Hz}$).

【産業上の利用可能性】

【0068】

L-乳酸の水酸基を保護した化合物は、たとえば抗真菌薬治療薬の原料として有用であり、(S)- β -ヒドロキシ- γ -ブチロラク톤や (S)-4-クロロ-3-ヒドロキシブタン酸エチルの水酸基を保護した化合物は、たとえば抗エイズ薬や高脂血症治療薬の

原料として有用であり、(S)-3-ヒドロキシテトラデカン酸エチルの水酸基を保護した化合物は、たとえば抗肥満薬治療薬の原料として有用である。

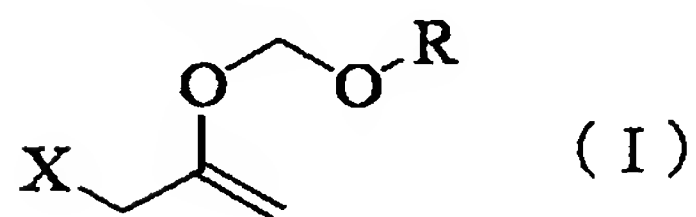
【書類名】 要約書

【要約】

【課題】 温和な条件で水酸基にアセタール型保護基を導入し得る方法およびそのための保護試薬を提供すること。

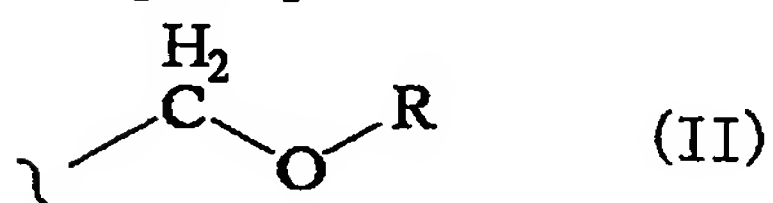
【解決手段】 一般式 (I) :

【化1】



(式中、Rは置換基を有していてもよいフェニル基または置換基を有していてもよいアルキル基を示し、Xはハロゲン原子を示す。) で表される化合物と水酸基含有化合物とを、酸触媒存在下反応させて、該水酸基含有化合物の水酸基の水素原子を、一般式 (II) :

【化2】



(式中、Rは前記と同義を示す。) で表される保護基に置換することを特徴とする、水酸基の保護方法。

【選択図】 なし

特願 2 0 0 3 - 2 8 8 3 0 0

出 願 人 履 歴 情 報

識別番号 [5 9 2 1 2 0 5 1 9]

1. 変更新月日	1 9 9 2 年 6 月 4 日
[変更理由]	新規登録
住 所	大阪市西淀川区歌島三丁目 1 番 2 1 号
氏 名	住化ファインケム株式会社